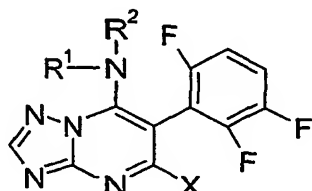


6-(2, 3, 6-TRIFLUORPHENYL) -TRIAZOLOPYRIMIDINE ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 6-(2,3,6-Trifluorphenyl)-triazolopyrimidine der Formel I



in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₃-C₈-Halogenycycloalkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkenyl, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

R² Wasserstoff oder eine der bei R¹ genannten Gruppen,

R¹ und R² können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann;

R¹ und/oder R² können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxy carbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Halogenalkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy, C₂-C₈-Alkynyl, C₂-C₈-Halogenalkynyl, C₃-C₆-Alkynyloxy, Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy, C₃-C₈-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, ali-

2

cyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

5 X Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₃-C₄-Halogenalkenyloxy.

Außerdem betrifft die Erfindung ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen.

10

5-Halogen-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-triazolopyrimidine sind aus EP-A 945 453 allgemein bekannt. 5-Cyano- und 5-Alkoxy-triazolopyrimidine sind in WO 02/083677 offenbart. Triazolopyrimidine mit optisch aktiven Aminosubstituenten in 7-Position werden in WO 02/38565 allgemein vorgeschlagen.

15

Die in den vorgenannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignet.

20

Ihre Wirkung ist jedoch nicht immer in jeder Hinsicht völlig zufriedenstellend. Davon ausgehend liegt der vorliegenden Erfindung die Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirkung und/oder verbreitertem Wirkungsspektrum bereitzustellen.

25

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Desweiteren wurde ein Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

30

Die erfindungsgemäßen Verbindungen unterscheiden sich von den in der vorgenannten Schrift beschriebenen durch die Substitution in der 5-Position des Triazolopyrimidin-Gerüsts.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit, bzw. ein verbreitertes Wirkungsspektrum gegen Schadpilze auf.

35

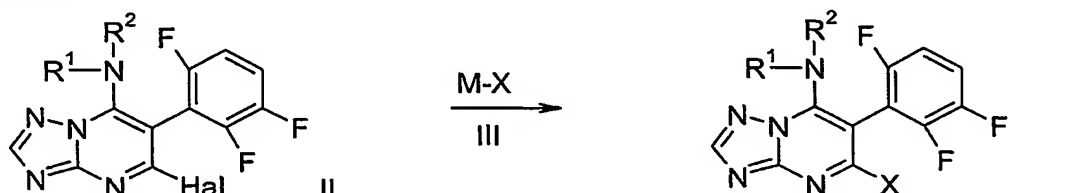
Die erfindungsgemäßen Verbindungen können auf verschiedenen Wegen erhalten werden. Vorteilhaft werden sie ausgehend von den aus EP-A 945 453 bekannten 5-Halogen-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II durch Umsetzung mit Verbindungen M-X (Formel III) erhalten. Verbindungen III stellen je nach der Bedeutung der einzuführenden Gruppe X ein anorganisches Cyanid oder ein Alkoxylat dar. Die Umsetzung erfolgt vorteilhaft in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels.

40

Das Kation M in Formel III hat geringe Bedeutung; aus praktischen Gründen sind übli-

3

cherweise Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetallsalze bevorzugt.



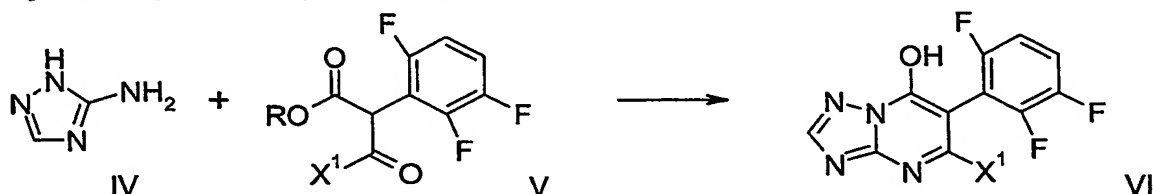
- 5 Üblicherweise liegt die Reaktionstemperatur bei 0 bis 120°C, bevorzugt bei 10 bis 40°C [vgl. J. Heterocycl. Chem., Bd.12, S. 861-863 (1975)].

Sofern R² Wasserstoff bedeutet, wird vorteilhaft vor Umsetzung mit III eine abspaltbare Schutzgruppe eingeführt [vgl. Greene, Protective Groups in Organic Chemistry, J. Wiley & Sons, (1981)].

10

Geeignete Lösungsmittel umfassen Ether, wie Dioxan, Diethylether und, bevorzugt Tetrahydrofuran, Alkohole, wie Methanol oder Ethanol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol oder Acetonitril.

- 15 Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht, können vorteilhaft durch folgenden Syntheseweg erhalten werden:



- Ausgehend von 2-Aminotriazol IV und Ketoestern V, wobei R C₁-C₄-Alkyl bedeutet, werden die 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine VI erhalten. In Formeln V und VI steht X¹ für C₁-C₄-Alkyl. Durch Verwendung der leicht zugänglichen 2-Phenylacetessigestern (V mit X¹=CH₃) werden die 5-Methyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine erhalten, die einen bevorzugten Gegenstand der Erfindung darstellen [vgl. Chem. Pharm. Bull., 9, 801, (1961)]. 2-Aminotriazol IV ist kommerziell erhältlich. Die Herstellung der Ausgangsverbindungen V erfolgt vorteilhaft unter den aus EP-A 10 02 788 beschriebenen Bedingungen.

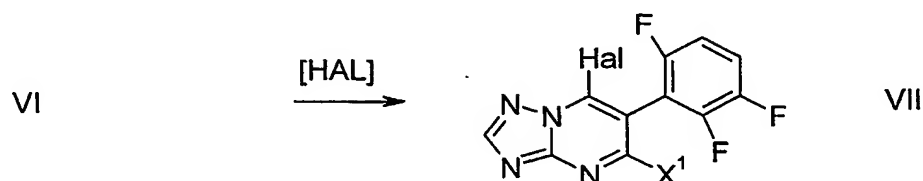
25

- Die so erhaltenen 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriazolopyrimidine werden mit Halogenierungsmitteln [HAL] unter den aus WO-A 94/20501 bekannten Bedingungen in die Halogenpyrimidine der Formel VII überführt, in der Hal ein Halogenatom, bevorzugt ein Brom oder ein Chloratom, insbesondere ein Chloratom bedeutet. Als Halogenierungsmittel [HAL] wird vorteilhaft ein Chlorierungs- oder Bromierungsmittel wie Phosphoro-

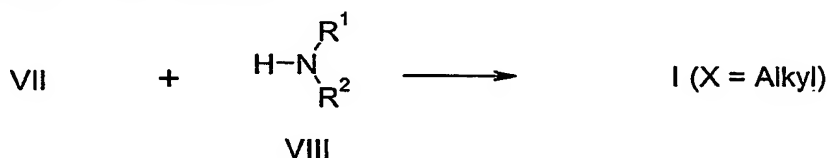
30

4

xybromid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thionylbromid oder Sulfurylchlorid eingesetzt.



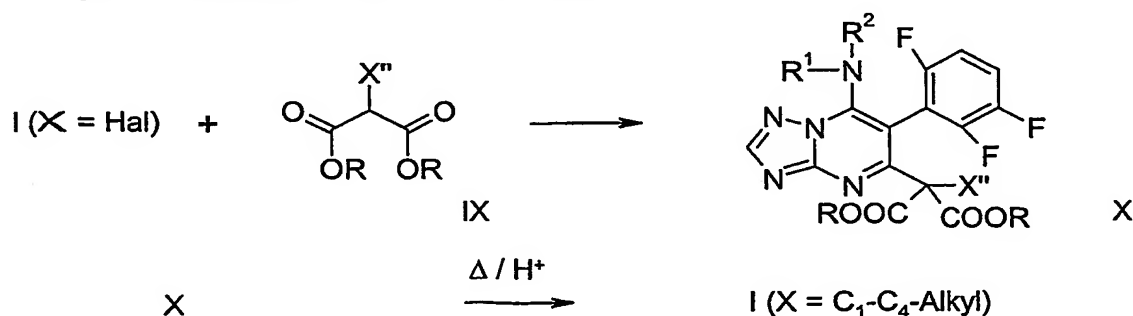
Diese Umsetzung wird üblicherweise bei 0°C bis 150°C, bevorzugt bei 80°C bis 125°C, durchgeführt [vgl. EP-A 770 615].



Die Umsetzung von VII mit Aminen VIII, wobei R¹ und R² wie in Formel I definiert sind, wird vorteilhaft bei 0°C bis 70°C, bevorzugt 10°C bis 35°C durchgeführt, vorzugsweise in Anwesenheit eines inerten Lösungsmittels, wie Ether, z. B. Dioxan, Diethylether oder insbesondere Tetrahydrofuran, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan und aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Toluol [vgl. WO-A 98/46608].

Die Verwendung einer Base, wie tertiäre Amine, beispielsweise Triethylamin oder anorganische Amine, wie Kaliumcarbonat ist bevorzugt; auch überschüssiges Amin der Formel VIII kann als Base dienen.

Verbindungen der Formel I, in der X C₁-C₄-Alkyl bedeutet, können alternativ auch aus Verbindungen I, in der X Halogen, insbesondere Chlor, bedeutet und Malonaten der Formel IX hergestellt werden. In Formel IX bedeuten X'' Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl und R C₁-C₄-Alkyl. Sie werden zu Verbindungen der Formel X umgesetzt und zu Verbindungen I decarboxyliert [vgl. US 5 994 360].



Die Malonate IX sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.

5

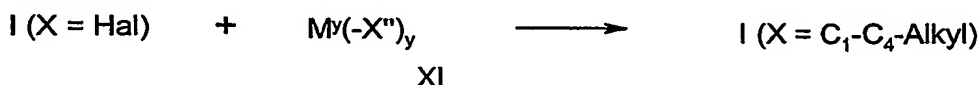
Die anschließende Verseifung des Esters X erfolgt unter allgemein üblichen Bedingungen, in Abhängigkeit der verschiedenen Strukturelemente kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen X vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I bereits ganz oder teilweise erfolgen.

5

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

- 10 Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropyl-
 15 ether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es
 20 können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

- Verbindungen der Formel I, in denen X für C₁-C₄-Alkyl steht, können auch durch Kupp-
 lung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel I, in der X Halogen bedeutet, mit
 metallorganischen Reagenzien der Formel XI erhalten werden. In einer Ausführungs-
 25 form dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.



- In Formel XI steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn und X'' für C₁-C₃-Alkyl. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Me-
 30 thoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

- 35 Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen- und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig er-

höher Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren oder Digerieren erfolgen.

- 5 Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

- 10 Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bekämpfenden Schadpilz erfolgen.

- 15 Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

- 20 Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen, z.B. C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

- 30 Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 2, 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können: insbesondere C₁-C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, 35 Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluorethyl oder 1,1,1-Trifluorprop-2-yl;

- 40 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger

Position, z.B. C₂-C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1-propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Doppelbindungen in beliebiger Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkynyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer oder zwei Dreifachbindungen in beliebiger Position, z.B. C₂-C₆-Alkynyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6 oder 8 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C₃-C₈-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S:

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isotiazolidinyl, 4-Isotiazolidinyl, 5-Isotiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl und 2-Piperazinyl;
- 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl und 2-Pyrazinyl;
- Alkylen: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, welche über eine Doppelbindung an das Gerüst gebunden sind, z. B. $=CH_2$, $=CH-CH_3$, $=CH-CH_2-CH_3$;
- Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH_2 -Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH_2O , OCH_2CH_2O und $OCH_2CH_2CH_2O$;

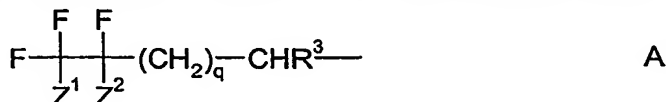
In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Raze-mate von Verbindungen der Formel I eingeschlossen, die chirale Zentren aufweisen.

9

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

- 5 Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R¹ für C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl steht.

Verbindungen I sind bevorzugt, in denen R¹ für eine Gruppe A steht:



- 10 worin

Z¹ Wasserstoff, Fluor oder C₁-C₆-Fluoroalkyl,

Z² Wasserstoff oder Fluor, oder

Z¹ und Z² bilden gemeinsam eine Doppelbindung;

- 15 q 0 oder 1 ist; und

R³ Wasserstoff oder Methyl bedeuten.

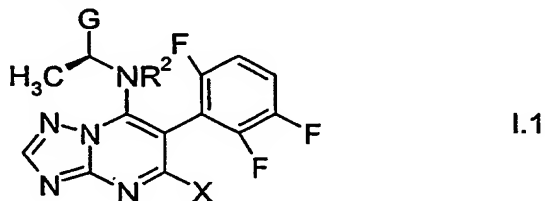
Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R¹ für C₃-C₆-Cycloalkyl steht, welches durch C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

- 20 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R² Wasserstoff bedeutet.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R² für Methyl oder Ethyl steht.

- 25 Sofern R¹ und/oder R² Halogenalkyl oder Halogenalkenylgruppen mit Chiralitätszentrum beinhalten, sind für diese Gruppen die (S)- Isomere bevorzugt. Im Fall halogenfreier Alkyl oder Alkenylgruppen mit Chiralitätszentrum in R¹ oder R² sind die (R)-konfigurierten Isomere bevorzugt.

Eine bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.1:



- 30

in der

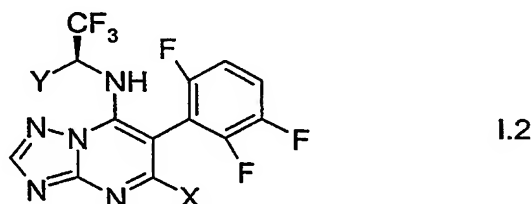
G C₂-C₆-Alkyl, insbesondere Ethyl, n- und i-Propyl, n-, sek-, tert- Butyl, und C₁-C₄-Alkoxyethyl, insbesondere Ethoxyethyl, oder C₃-C₆-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopentyl oder Cyclohexyl;

10

R² Wasserstoff oder Methyl; und

X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

- 5 Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen der Formel I.2.

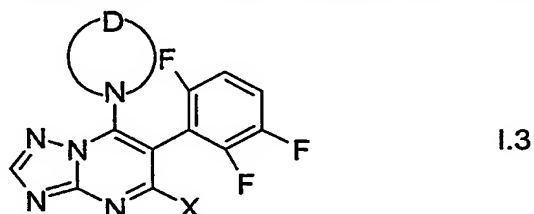


in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl, insbesondere für Methyl und Ethyl, und X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere für Cyano, Methoxy oder Ethoxy steht.

10

Eine weitere bevorzugte Ausführungsform der Erfindung betrifft Verbindungen, in denen R¹ und R² zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten

- 15 und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann. Diese Verbindungen entsprechen insbesondere Formel I.3,



20 in der

D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann; und

25

X gemäß Formel I definiert sind, insbesondere Cyano, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

30

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Piperidiny-, Morpholiny- oder Thiomorpholinyring bilden, insbesondere einen Piperidinyring, der ggf. durch eine bis drei Gruppen Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiert ist. Besonders bevorzugt sind die Verbindungen, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen 4-Methylpiperidinring bilden.

Ein weiterer bevorzugter Gegenstand der Erfindung sind Verbindungen I, in denen R^1 und R^2 zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen Pyrazolring bilden, der ggf. durch eine oder zwei Gruppen Halogen, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl, insbesondere durch 3,5-Dimethyl oder 3,5-Di-(trifluormethyl) substituiert ist.

Daneben sind auch Verbindungen der Formel I besonders bevorzugt, in denen $R^1CH(CH_3)-CH_2CH_3$, $CH(CH_3)-CH(CH_3)_2$, $CH(CH_3)-C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)-CF_3$, $CH_2C(CH_3)=CH_2$, $CH_2CH=CH_2$, Cyclopentyl oder Cyclohexyl; R^2 Wasserstoff oder Methyl; oder R^1 und R^2 gemeinsam $-(CH_2)_2CH(CH_3)(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_2CH(CF_3)(CH_2)_2-$ oder $-(CH_2)_2O(CH_2)_2-$ bedeuten.

Weiterhin werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X Cyano, Methoxy oder Ethoxy, insbesondere Cyano oder Methoxy bedeutet.

In einer anderen bevorzugten Ausgestaltung der Verbindungen der Formel I bedeutet X C_1 - C_4 -Alkyl, insbesondere Methyl.

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den folgenden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des betreffenden Substituenten dar.

Tabelle 1

Verbindungen der Formel I, in denen X Cyano bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 2

Verbindungen der Formel I, in denen X Methoxy bedeutet und die Kombination von R^1 und R^2 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

Verbindungen der Formel I, in denen X Ethoxy bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 4

Verbindungen der Formel I, in denen X Methyl bedeutet und die Kombination von R¹ und R² für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle A

Nr.	R ¹	R ²
A-1	CH ₃	H
A-2	CH ₃	CH ₃
A-3	CH ₂ CH ₃	H
A-4	CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-5	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-6	CH ₂ CF ₃	H
A-7	CH ₂ CF ₃	CH ₃
A-8	CH ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-9	CH ₂ CCl ₃	H
A-10	CH ₂ CCl ₃	CH ₃
A-11	CH ₂ CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-12	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-13	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-14	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-15	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-16	CH(CH ₃) ₂	H
A-17	CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-18	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H
A-20	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-21	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-22	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-23	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-24	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-25	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-26	(±) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-27	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-28	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-29	(S) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-30	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	H
A-31	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₃
A-32	(R) CH(CH ₃)-CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-33	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-34	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-35	(±) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-36	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-37	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-38	(S) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-39	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	H
A-40	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₃
A-41	(R) CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃
A-42	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-43	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-44	(±) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-45	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-46	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-47	(S) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-48	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	H
A-49	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₃
A-50	(R) CH(CH ₃)-C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃
A-51	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-52	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-53	(±) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-54	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-55	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-56	(S) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-57	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	H
A-58	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₃
A-59	(R) CH(CH ₃)-CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-60	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-61	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-62	(±) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-63	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-64	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-65	(S) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃

Nr.	R ¹	R ²
A-66	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	H
A-67	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₃
A-68	(R) CH(CH ₃)-CCl ₃	CH ₂ CH ₃
A-69	CH ₂ CF ₂ CF ₃	H
A-70	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₃
A-71	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-72	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	H
A-73	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₃
A-74	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CH ₂ CH ₃
A-75	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
A-76	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₃
A-77	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-78	CH ₂ CH=CH ₂	H
A-79	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₃
A-80	CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH ₃
A-81	CH ₂ -C≡CH	H
A-82	CH ₂ -C≡CH	CH ₃
A-83	CH ₂ -C≡CH	CH ₂ CH ₃
A-84	Cyclopentyl	H
A-85	Cyclopentyl	CH ₃
A-86	Cyclopentyl	CH ₂ CH ₃
A-87	Cyclohexyl	H
A-88	Cyclohexyl	CH ₃
A-89	Cyclohexyl	CH ₂ CH ₃
A-90	CH ₂ -C ₆ H ₅	H
A-91	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₃
A-92	CH ₂ -C ₆ H ₅	CH ₂ CH ₃
A-93	-(CH ₂) ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-94	-(CH ₂) ₂ C(CH ₃)=CHCH ₂ -	
A-95	-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-96	-(CH ₂) ₃ CHFCH ₂ -	
A-97	-(CH ₂) ₂ CHF(CH ₂) ₂ -	
A-98	-CH ₂ CHF(CH ₂) ₃ -	
A-99	-(CH ₂) ₂ CH(CF ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-100	-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	
A-101	-(CH ₂) ₂ S(CH ₂) ₂ -	
A-102	-(CH ₂) ₅ -	

15

Nr.	R ¹	R ²
A-103	-(CH ₂) ₄ -	
A-104	-CH ₂ CH=CHCH ₂ -	
A-105	-CH(CH ₃)(CH ₂) ₃ -	
A-106	-CH ₂ CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ -	
A-107	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-	
A-108	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-109	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	
A-110	-(CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	
A-111	-CH(CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₄ -	
A-112	-(CH ₂) ₂ -CHOH-(CH ₂) ₂ -	
A-113	-(CH ₂)-CH=CH-(CH ₂) ₂ -	
A-114	-(CH ₂) ₆ -	
A-115	-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -	
A-116	-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	
A-117	-N=CH-CH=CH-	
A-118	-N=C(CH ₃)-CH=C(CH ₃)-	
A-119	-N=C(CF ₃)-CH=C(CF ₃)-	

- Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich aus durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Oomyceten* und *Basidiomyceten*. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

- Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Bipolaris*- und *Drechslera*-Arten an Getreide, Reis und Rasen,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Getreide, Bananen und Erdnüssen,

16

- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 5 • *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria tritici* und *Stagonospora nodorum* an Weizen,
- 10 • *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

15 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Pae-
cilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich,
Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

20 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu
schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid
wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch
nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

25 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwi-
schen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des
gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

30 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 1 bis
1000 g/100 kg, vorzugsweise 5 bis 100 g je 100 Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an
Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Auf-
wandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise
35 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lö-
sungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die An-
wendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem

Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiernmitteln. Als Lösungsmittel / Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

- Wasser, aromatische Lösungsmittel (z.B. Solvesso Produkte, Xylol), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol, Pentanol, Benzylalkohol), Ketone (z.B. Cyclohexanon, gamma-Butyrolacton), Pyrrolidone (NMP, NOP), Acetate (Glykoldiacetat), Glykole, Dimethylfettsäureamide, Fettsäuren und Fettsäureester. Grundsätzlich können auch Lösungsmittelgemische verwendet werden,
- Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylenfettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiernmittel wie Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate, Fettsäuren und sulfatierte Fettalkoholglykoether zum Einsatz, ferner Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Tristerylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Alkohol- und Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

10

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

15

Beispiele für Formulierungen sind: 1. Produkte zur Verdünnung in Wasser

A Wasserlösliche Konzentrate (SL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Wasser oder einem wasserlöslichen Lösungsmittel gelöst. Alternativ werden Netzmittel oder andere Hilfsmittel zugefügt. Bei der Verdünnung in Wasser löst sich der Wirkstoff.

B Dispergierbare Konzentrate (DC)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Cyclohexanon unter Zusatz eines Dispergiemittels z.B. Polyvinylpyrrolidon gelöst. Bei Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Dispersion.

C Emulgierbare Konzentrate (EC)

15 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

D Emulsionen (EW, EO)

40 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in Xylol unter Zusatz von Ca-Dodecylbenzolsulfonat und Ricinusölethoxylat (jeweils 5 %) gelöst. Diese Mischung wird mittels einer Emulgiermaschine (Ultraturax) in Wasser eingebracht und zu einer homogenen Emulsion gebracht. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine Emulsion.

40

E Suspensionen (SC, OD)

20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln und Wasser oder einem organischen Lösungsmittel in einer Rührwerkskugelmühle zu einer feinen Wirkstoffsuspension zerkleinert. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Suspension des Wirkstoffs.

F Wasserdispersgierbare und wasserlösliche Granulate (WG, SG)

50 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln fein gemahlen und mittels technischer Geräte (z.B. Extrusion, Sprühturm, Wirbelschicht) als wasserdispersgierbare oder wasserlösliche Granulate hergestellt. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

G Wasserdispersgierbare und wasserlösliche Pulver (WP, SP)

75 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden unter Zusatz von Dispergier- und Netzmitteln sowie Kieselsäuregel in einer Rotor-Strator Mühle vermahlen. Bei der Verdünnung in Wasser ergibt sich eine stabile Dispersion oder Lösung des Wirkstoffs.

2. Produkte für die Direktapplikation**H Stäube (DP)**

5 Gew.Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95 % feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält dadurch ein Stäubemittel.

I Granulate (GR, FG, GG, MG)

0.5 Gew-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden fein gemahlen und mit 95.5 % Trägerstoffe verbunden. Gängige Verfahren sind dabei die Extrusion, die Sprühtrocknung oder die Wirbelschicht. Man erhält dadurch ein Granulat für die Direktapplikation.

J ULV- Lösungen (UL)

10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einem organischen Lösungsmittel z.B. Xylol gelöst. Dadurch erhält man ein Produkt für die Direktapplikation.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder

20

Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

- 5 Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netz-
baren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet wer-
den. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-
stanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber
10 auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und even-
tuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Ver-
dünnung mit Wasser geeignet sind.

- 15 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in
größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und
10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

- Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV)
verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-%
20 Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

- Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Netzmittel, Adjuvants, Herbizide,
Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch
erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können
25 zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt
werden.

- Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zu-
sammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden,
30 Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der
Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide
mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden
Wirkungsspektrums.

- 35 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen
gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern,
nicht aber einschränken:

- Acylalanine wie Benalaxyl, Metalaxyl, Ofurace, Oxadixyl,

21

- Aminderivate wie Aldimorph, Dodine, Dodemorph, Fenpropimorph, Fenpropidin, Guazatine, Iminoctadine, Spiroxamin, Tridemorph
- Anilinopyrimidine wie Pyrimethanil, Mepanipyrim oder Cyrodinyl,
- Antibiotika wie Cycloheximid, Griseofulvin, Kasugamycin, Natamycin, Polyoxin oder
5 Streptomycin,
- Azole wie Bitertanol, Bromoconazol, Cyproconazol, Difenoconazole, Dinitroconazol, Enilconazol, Epoxiconazol, Fenbuconazol, Fluquiconazol, Flusilazol, Hexaconazol, Imazalil, Metconazol, Myclobutanil, Penconazol, Propiconazol, Prochloraz, Prothioconazol, Tebuconazol, Triadimefon, Triadimenol, Triflumizol, Triticonazol,
- 10 • Dicarboximide wie Iprodion, Myclozolin, Procymidon, Vinclozolin,
- Dithiocarbamate wie Ferbam, Nabam, Maneb, Mancozeb, Metam, Metiram, Propineb, Polycarbamat, Thiram, Ziram, Zineb,
- Heterocyclische Verbindungen wie Anilazin, Benomyl, Boscalid, Carbendazim, Carboxin, Oxycarboxin, Cyazofamid, Dazomet, Dithianon, Famoxadon, Fenamidon,
15 Fenarimol, Fuberidazol, Flutolanil, Furametpyr, Isoprothiolan, Mepronil, Nuarimol, Probenazol, Proquinazid, Pyrifenox, Pyroquilon, Quinoxifen, Silthiofam, Thiabendazol, Thifluzamid, Thiophanat-methyl, Tiadinil, Tricyclazol, Triforine,
- Kupferfungizide wie Bordeaux Brühe, Kupferacetat, Kupferoxychlorid, basisches Kupfersulfat,
- 20 • Nitrophenylderivate, wie Binapacryl, Dinocap, Dinobuton, Nitrophthal-isopropyl
- Phenylpyrrole wie Fenpiclonil oder Fludioxonil,
- Schwefel
- Sonstige Fungizide wie Acibenzolar-S-methyl, Benthiavalicarb, Carpropamid, Chlorothalonil, Cyflufenamid, Cymoxanil, Dazomet, Diclomezin, Diclocymet, Diethofencarb, Edifenphos, Ethaboxam, Fenhexamid, Fentin-Acetat, Fenoxanil, Ferimzone,
25 Fluazinam, Fosetyl, Fosetyl-Aluminium, Iprovalicarb, Hexachlorbenzol, Metrafenon, Pencycuron, Propamocarb, Phthalid, Toloclofos-methyl, Quintozene, Zoxamid
- Strobilurine wie Azoxystrobin, Dimoxystrobin, Fluoxastrobin, Kresoxim-methyl, Metominostrobin, Orysastrobin, Picoxystrobin, Pyraclostrobin oder Trifloxystrobin,
- 30 • Sulfensäurederivate wie Captafol, Captan, Dichlofluamid, Folpet, Tolyfluanid
- Zimtsäureamide und Analoge wie Dimethomorph, Flumetover oder Flumorph.

Synthesebeispiele

- 35 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

22

Beispiel 1: Herstellung von 5-Cyano-6-(2,3,6-trifluor-phenyl)-7-(2-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

5 Eine Lösung von 0,2 g (0,5 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluor-phenyl)-7-(2-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP-A 945 453] und 0,5 g (3,3 mmol) Tetrabutylammoniumcyanid in 2 ml Acetonitril wurden 14 Std. bei 20-25°C gerührt. Anschließend dampfte man die Reaktionsmischung im Vakuum ein und reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril/Wasser-Gemischen. Aus dem Eluat erhielt man 0,13 g der Titelverbindung als farblosen Festkörper vom Fp 173-177°C.

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,4 (m, 1H); 7,1 (m, 1H); 4,65 (m, 1H); 3,1-3,4 (m, 2H); 1,8-1,9 (m, 1H); 1,6-1,8 (m, 3H); 1,5 (m, 2H); 1,25 (m, 3H).

15 Beispiel 2: Herstellung von 5-Methoxy-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-cyclopentylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

20 Eine Lösung von 0,2 g (0,5 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluor phenyl)-7-cyclopentylamino-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP 945 453] in 5 ml Methanol wurde nach Zusatz von 0,12 g 30 %iger Natrium-methanolat-Lsg. 24 Std. bei 20-25°C, dann 3 Std. bei 50°C gerührt, nach Zugabe weiterer 0,12 g 30 % iger Natrium-methanolat-Lsg. 8 Std. bei 50°C, nach erneuter Zugabe von 0,2 g 30 % ige Natrium-methanolat-Lsg. 4 Std. bei 60°C, dann 18 Std. bei 20-25°C gerührt. Anschließend dampfte man die Reaktionsmischung im Vakuum ein und reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über
25 Kieselgel RP-18 mit Acetonitril-Wasser-Gemischen. Aus dem Eluat erhielt man 0,13 g der Titelverbindung als gelbes Harz.

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,2 (s, 1H); 7,3 (m, 1H); 6,95 (m, 1H); 6,2 (d, 1H); 4,0 (s, 3H); 3,55 (m, 1H); 1,65 (m, 4H); 1,5 (m, 4H)

30 Beispiel 3: Herstellung von 5-Methyl-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-(2-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin

35 Eine Lösung von 0,6 g (1,6 mmol) 5-Chlor-6-(2,3,6-trifluorphenyl)-7-(2-methylpiperidiny)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [vgl. EP 945 453] und 0,6 g (4 mmol) Natrium-dimethylmalonat in 5 ml Acetonitril wurde ca. 5 Std. bei 80°C gerührt. Dabei fiel ein gelber Festkörper aus. Anschließend saugte man die Reaktionsmischung über Kieselgur ab, nahm den gelben Festkörper in Methylenchlorid und verdünnter Salzsäure auf und rührte die Suspension ca. 15 min bei 20-25°C. Dann wurden die Phasen
40 getrennt, die organische Phase wurde getrocknet und vom Lösungsmittel befreit.

- Der erhaltene Rückstand wurde – ohne Reinigung – in 10 ml konz. Salzsäure aufgenommen und die Reaktionsmischung wurde 3 Std. bei 80-90°C gerührt. Dann verdünnte man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahierte die wässrige Phase mit
- 5 Methylenchlorid. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und vom Lösungsmittel befreit. Man reinigte den Rückstand mittels präparativer MPLC über Kieselgel RP-18 mit Acetonitril-Wasser-Gemischen und Digerieren in Hexan. Man erhielt 0,2 g der Titelverbindung als hellen Festkörper vom Fp 108-110°C.
- 10 ¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,4 (s, 1H); 7,3 (m, 1H); 7,0 (m, 1H); 4,2 (m, 1H); 3,05-3,25 (m, 2H); 2,4 (s, 3H); 1,25-1,75 (m, 6H); 1,05 (m, 3H)

Tabelle I - Verbindungen der Formel I:

Nr.	R ¹	R ²	X	Phys. Daten Fp [°C]
I-1	2-Methylpiperidinyl		-CN	173-177
I-2	Cyclopentyl	H	-OCH ₃	(s. Bsp. 2)
I-3	2-Methylpiperidinyl		-CH ₃	108-110
I-4	Cyclopentyl	H	-CN	130-145

15

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

20

- Die Wirkstoffe wurden als eine Stammlösung aufbereitet mit 25 mg Wirkstoff, welcher mit einem Gemisch aus Aceton und/oder DMSO und dem Emulgator Uniperol® EL (Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) im Volumen-Verhältnis Lösungsmittel-Emulgator von 99 zu 1 ad 10 ml aufgefüllt
- 25 wurde. Anschließend wurde ad 100 ml mit Wasser aufgefüllt. Diese Stammlösung wurde mit dem beschriebenen Lösungsmittel-Emulgator-Wasser Gemisch zu der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration verdünnt.

- Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste verursacht durch *Pyrenophora teres* bei protektiver Anwendung

30

- Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte "Hanna" wurden mit wässriger Suspension in der unten angegebenen Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfnässe besprüht. 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die
- 35 Versuchspflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn.

Drechslera] teres, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

5

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, bzw. I-4 behandelten Pflanzen nicht über 7 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

- 10 Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen den Grauschimmel an Paprikablättern verursacht durch *Botrytis cinerea* bei protektiver Anwendung

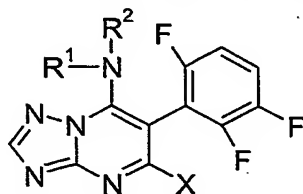
Paprikasämlinge der Sorte "Neusiedler Ideal Elite" wurden, nachdem sich 2 bis 3 Blätter gut entwickelt hatten, mit einer wässrigen Suspension in der unten angegebenen

- 15 Wirkstoffkonzentration bis zur Tropfrösse besprüht. Am nächsten Tag wurden die behandelten Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Botrytis cinerea*, die $1,7 \times 10^6$ Sporen/ml in einer 2 %igen wässrigen Biomazlösung enthielt, inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in eine Klimakammer mit 22 bis 24°C, Dunkelheit und hoher Luftfeuchtigkeit gestellt. Nach 5 Tagen konnte das Ausmaß des Pilzbefalls auf den
- 20 Blättern visuell in % ermittelt werden.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Verbindungen I-1, I-2, I-3, bzw. I-4 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

Patentansprüche

1. 6-(2,3,6-Trifluorphenyl)-triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

10 R^1 C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_3 - C_8 -Halogenacycloalkyl, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Halogenacycloalkenyl, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl oder Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

15 R^2 Wasserstoff oder eine der bei R^1 genannten Gruppen,

20 R^1 und R^2 können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bilden, welches über N gebunden ist und ein bis drei weitere Heteroatome aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_3 - C_6 -Alkenyloxy, C_3 - C_6 -Halogenalkenyloxy, (exo)- C_1 - C_6 -Alkylen und Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy tragen kann;

25 R^1 und/oder R^2 können eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a tragen:

30 R^a Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylthio, C_1 - C_6 -Alkylamino, Di- C_1 - C_6 -alkylamino, C_2 - C_8 -Alkenyl, C_2 - C_8 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Alkenyloxy, C_2 - C_8 -Alkynyl, C_2 - C_8 -Halogenalkynyl, C_3 - C_6 -Alkinyloxy, Oxy- C_1 - C_3 -alkylenoxy, C_3 - C_6 -Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- oder sechsgliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder

35

26

aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können;

5 X Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₃-C₄-Halogenalkenyloxy.

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₄-Alkenyloxy, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₃-C₄-Halogenalkenyloxy bedeutet.

10 3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Cyano bedeutet.

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X Methyl bedeutet.

15 5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2, in der X Methoxy bedeutet.

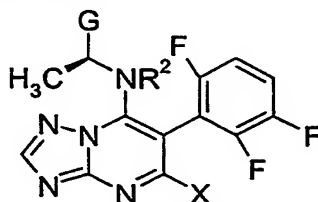
6. Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, in der R¹ und R² folgende Bedeutung haben:

20 R¹ CH(CH₃)-CH₂CH₃, CH(CH₃)-CH(CH₃)₂, CH(CH₃)-C(CH₃)₃, CH(CH₃)-CF₃, CH₂C(CH₃)=CH₂, CH₂CH=CH₂, Cyclopentyl, Cyclohexyl;

R² Wasserstoff oder Methyl; oder

25 R¹ und R² bilden gemeinsam -(CH₂)₂CH(CH₃)(CH₂)₂-, -(CH₂)₂CH(CF₃)(CH₂)₂- oder -(CH₂)₂O(CH₂)₂-.

7. Verbindungen der Formel I.1:



I.1

30 in der

G C₂-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxymethyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl;

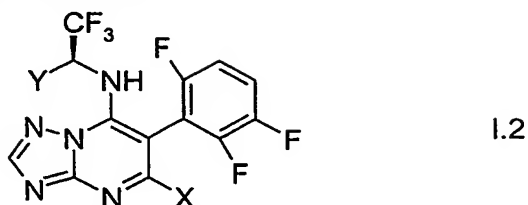
R² Wasserstoff oder Methyl; und

X Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

35

27

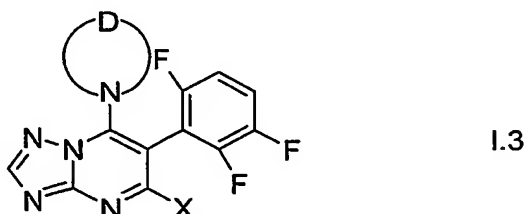
8. Verbindungen der Formel I.2.



in der Y für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl und X für Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy steht.

5

9. Verbindungen der Formel I.3,



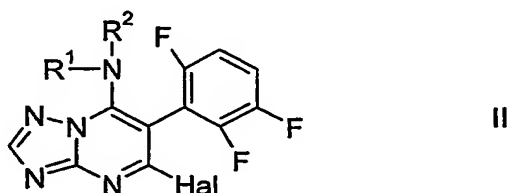
in der

- 10 D zusammen mit dem Stickstoffatom ein fünf- oder sechsgliedriges Heterocyclyl oder Heteroaryl bildet, welches über N gebunden ist und ein weiteres Heteroatom aus der Gruppe O, N und S als Ringglied enthalten und/oder einen oder mehrere Substituenten aus der Gruppe Halogen, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Halogenalkenyloxy, (exo)-C₁-C₆-Alkylen und Oxy-C₁-C₃-alkylenoxy tragen kann; und

15

X Cyano, Methyl, Methoxy oder Ethoxy bedeuten.

- 20 10. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 2, durch Umsetzung von 5-Halogen-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-triazolopyrimidinen der Formel II



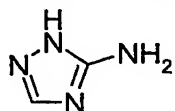
in der Hal für ein Halogenatom steht, mit Verbindungen der Formel III

25



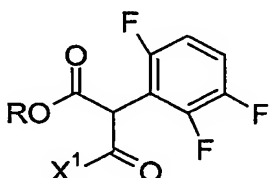
in der M für ein Ammonium-, Tetraalkylammonium- oder Alkali- oder Erdalkalimetall-Kation steht und X die Bedeutung gemäß Anspruch 1 hat.

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der X C₁-C₄-Alkyl bedeutet, durch Umsetzung von 2-Aminotriazol der Formel IV



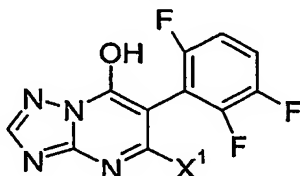
IV

- 5 mit Ketoestern der Formel V,



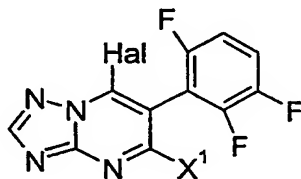
V

in der R und X¹ unabhängig voneinander C₁-C₄-Alkyl bedeuten, zu 5-Alkyl-7-hydroxy-6-phenyltriaxolopyrimidinen der Formel VI,



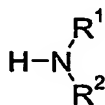
VI

- 10 Halogenierung von VI mit Halogenierungsmitteln zu Halogenpyrimidinen der Formel VII,



VII

in der Hal für ein Halogenatom steht, und Umsetzung von VII mit Aminen der Formel VIII,



VIII

- 15 in der R¹ und R² die Bedeutung wie in Formel I haben.

12. Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2.

20

13. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 in einer Menge von 1 bis 1000 g/100 kg

25

14. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materia-

lien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 oder 2 behandelt.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/014206

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 7 C07D487/04 A01N43/90

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	EP 0 945 453 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 29 September 1999 (1999-09-29) cited in the application Beispiele the whole document	1-14
Y	WO 99/31255 A (GENENCOR INTERNATIONAL, INC; BOWER, BENJAMIN, S; FOWLER, TIMOTHY; PHIL) 24 June 1999 (1999-06-24) Beispiele the whole document	1-14
A	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24 October 2002 (2002-10-24) cited in the application the whole document	1-14
-/-		



Further documents are listed in the continuation of box C.



Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- *G* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

1 April 2005

Date of mailing of the international search report

11/04/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP2004/014206

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16 May 2002 (2002-05-16) cited in the application the whole document -----	1-14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014206

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0945453	A	29-09-1999	AT 239727 T	15-05-2003
			AT 228133 T	15-12-2002
			AU 752669 B2	26-09-2002
			AU 3098599 A	18-10-1999
			AU 735730 B2	12-07-2001
			AU 6867198 A	11-11-1998
			BG 64197 B1	30-04-2004
			BG 103805 A	30-06-2000
			BR 9808531 A	23-05-2000
			BR 9909009 A	28-11-2000
			CA 2287470 A1	22-10-1998
			CA 2324154 A1	30-09-1999
			CN 1302299 A ,C	04-07-2001
			CN 1528762 A	15-09-2004
			CZ 20003472 A3	16-01-2002
			CZ 292092 B6	16-07-2003
			DE 69814375 D1	12-06-2003
			DE 69814375 T2	24-12-2003
			DE 69903988 D1	02-01-2003
			DE 69903988 T2	27-03-2003
			DK 975635 T3	02-06-2003
			DK 945453 T3	16-12-2002
			EA 2906 B1	31-10-2002
			EA 3281 B1	24-04-2003
			EE 9900486 A	15-06-2000
			EP 0975635 A1	02-02-2000
			EP 0945453 A1	29-09-1999
			EP 1066291 A1	10-01-2001
			ES 2188094 T3	16-06-2003
			HU 0001993 A2	28-10-2000
			HU 0101751 A2	28-10-2001
			IL 132238 A	29-05-2003
			JP 11322750 A	24-11-1999
			JP 2001520650 T	30-10-2001
			JP 2003522100 T	22-07-2003
			NO 994973 A	13-10-1999
			NZ 500143 A	29-06-2001
			PL 343176 A1	30-07-2001
			PT 945453 T	31-03-2003
			SI 975635 T1	31-10-2003
			SK 141499 A3	11-09-2001
			WO 9948893 A1	30-09-1999
			US 6284762 B1	04-09-2001
			ZA 200005867 A	22-10-2001
WO 9931255	A	24-06-1999	AU 1726299 A	05-07-1999
			CA 2315017 A1	24-06-1999
			EP 1038008 A2	27-09-2000
			JP 2003527065 T	16-09-2003
			NZ 505295 A	20-12-2002
			WO 9931255 A2	24-06-1999
WO 02083677	A	24-10-2002	AT 274518 T	15-09-2004
			DE 60201089 D1	30-09-2004
			DE 60201089 T2	30-12-2004
			WO 02083677 A1	24-10-2002
			EP 1381610 A1	21-01-2004
			JP 2004526767 T	02-09-2004

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/014206

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 02083677 A		US 2004110751 A1	10-06-2004
WO 0238565 A	16-05-2002	AU 2183102 A	21-05-2002
		WO 0238565 A2	16-05-2002
		EP 1368351 A2	10-12-2003
		JP 2004513170 T	30-04-2004
		US 2004110771 A1	10-06-2004

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014206

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D487/04 A01N43/90

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
Y	EP 0 945 453 A (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 29. September 1999 (1999-09-29) in der Anmeldung erwähnt Beispiele das ganze Dokument	1-14
Y	WO 99/31255 A (GENENCOR INTERNATIONAL, INC; BOWER, BENJAMIN, S; FOWLER, TIMOTHY; PHIL) 24. Juni 1999 (1999-06-24) Beispiele das ganze Dokument	1-14
A	WO 02/083677 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 24. Oktober 2002 (2002-10-24) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-14

-/--

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

1. April 2005

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

11/04/2005

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Fritz, M

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 02/38565 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; DITRICH, KLAUS; SAUTER) 16. Mai 2002 (2002-05-16) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument -----	1-14

INTERNATIONALE RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014206

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0945453 A	29-09-1999	AT 239727 T	15-05-2003
		AT 228133 T	15-12-2002
		AU 752669 B2	26-09-2002
		AU 3098599 A	18-10-1999
		AU 735730 B2	12-07-2001
		AU 6867198 A	11-11-1998
		BG 64197 B1	30-04-2004
		BG 103805 A	30-06-2000
		BR 9808531 A	23-05-2000
		BR 9909009 A	28-11-2000
		CA 2287470 A1	22-10-1998
		CA 2324154 A1	30-09-1999
		CN 1302299 A ,C	04-07-2001
		CN 1528762 A	15-09-2004
		CZ 20003472 A3	16-01-2002
		CZ 292092 B6	16-07-2003
		DE 69814375 D1	12-06-2003
		DE 69814375 T2	24-12-2003
		DE 69903988 D1	02-01-2003
		DE 69903988 T2	27-03-2003
		DK 975635 T3	02-06-2003
		DK 945453 T3	16-12-2002
		EA 2906 B1	31-10-2002
		EA 3281 B1	24-04-2003
		EE 9900486 A	15-06-2000
		EP 0975635 A1	02-02-2000
		EP 0945453 A1	29-09-1999
		EP 1066291 A1	10-01-2001
		ES 2188094 T3	16-06-2003
		HU 0001993 A2	28-10-2000
		HU 0101751 A2	28-10-2001
		IL 132238 A	29-05-2003
		JP 11322750 A	24-11-1999
		JP 2001520650 T	30-10-2001
		JP 2003522100 T	22-07-2003
		NO 994973 A	13-10-1999
		NZ 500143 A	29-06-2001
		PL 343176 A1	30-07-2001
		PT 945453 T	31-03-2003
		SI 975635 T1	31-10-2003
		SK 141499 A3	11-09-2001
		WO 9948893 A1	30-09-1999
		US 6284762 B1	04-09-2001
		ZA 200005867 A	22-10-2001
WO 9931255 A	24-06-1999	AU 1726299 A	05-07-1999
		CA 2315017 A1	24-06-1999
		EP 1038008 A2	27-09-2000
		JP 2003527065 T	16-09-2003
		NZ 505295 A	20-12-2002
		WO 9931255 A2	24-06-1999
WO 02083677 A	24-10-2002	AT 274518 T	15-09-2004
		DE 60201089 D1	30-09-2004
		DE 60201089 T2	30-12-2004
		WO 02083677 A1	24-10-2002
		EP 1381610 A1	21-01-2004
		JP 2004526767 T	02-09-2004

INTERNATIONAL RESEARCH REPORT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/014206

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 02083677 A		US 2004110751 A1	10-06-2004
WO 0238565 A	16-05-2002	AU 2183102 A	21-05-2002
		WO 0238565 A2	16-05-2002
		EP 1368351 A2	10-12-2003
		JP 2004513170 T	30-04-2004
		US 2004110771 A1	10-06-2004